

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 11 月 10 日 (10.11.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/105742 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07D 211/32, B01J 25/02
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2005/008028
- (22) 国際出願日: 2005 年 4 月 27 日 (27.04.2005)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2004-133277 2004 年 4 月 28 日 (28.04.2004) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): エーザイ株式会社 (EISAI CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1128088 東京都文京区小石川 4 丁目 6 番 1 0 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 今井昭生 (IMAI, Akio) [JP/JP]; 〒3140255 茨城県鹿島郡波崎町大字砂山 2 2 番地 エーザイ株式会社 鹿島事業所内 Ibaraki (JP). 西村博 (NISHIMURA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒3140255 茨城県鹿島郡波崎町大字砂山 2 2 番地 エーザイ株式会社 鹿島事業所内 Ibaraki (JP).
- (74) 共通の代表者: エーザイ株式会社 (EISAI CO., LTD.); 〒1128088 東京都文京区小石川 4 丁目 6 番 1 0 号 Tokyo (JP).

- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESSES FOR PRODUCING 1-BENZYL-4-[(5,6-DIMETHOXY-1-INDANON)-2-YL]METHYLPIPERIDINE AND HYDROCHLORIDE THEREOF

(54) 発明の名称: 1-ベンジル-4-[(5,6-ジメトキシ-1-インダノン)-2-イル]メチルピペリジンおよびその塩酸塩の製造法

(57) Abstract: Processes for producing 1-benzyl-4-[(5,6-dimethoxy-1-indanon)-2-yl]methylpiperidine (donepezil), which is useful as an intermediate for medicines, and for producing 1-benzyl-4-[(5,6-dimethoxy-1-indanon)-2-yl]methylpiperidine hydrochloride (donepezil hydrochloride), which is useful as a medicine. The process for donepezil hydrochloride production comprises catalytically hydrogenating the compound represented by the structural formula (III) [1-benzyl-4-[(5,6-dimethoxy-1-indanon)-2-ylidene]methylpiperidine] with a Raney nickel catalyst under mild conditions and subsequently treating it with hydrochloric acid. Thus, impurities are further diminished. The operations are simple and the process is suitable for industrial production.

(57) 要約: 本発明は、医薬の中間原料として有用な 1-ベンジル-4-[(5,6-ジメトキシ-1-インダノン)-2-イル]メチルピペリジン (ドネペジル) および医薬として有用な 1-ベンジル-4-[(5,6-ジメトキシ-1-インダノン)-2-イル]メチルピペリジン塩酸塩 (塩酸ドネペジル) の製造法に関し、構造式 (I) の化合物 [1-ベンジル-4-[(5,6-ジメトキシ-1-インダノン)-2-イル]メチルピペリジン] を、ラネーニッケル触媒を使用し、緩和な条件下で接触水素化し、次いで塩酸処理することにより、不純物がより低減され、操作が簡便で工業生産に適した、塩酸ドネペジルの製造方法を提供する。